PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 333/38, A01N 37/22, C07D 231/14, 213/82, C07C 233/75, C07D 277/56, 327/06

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 98/03500

A1 (43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

29. Januar 1998 (29.01.98)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP97/03694

(22) Internationales Anmeldedatum:

11. Juli 1997 (11.07.97)

(30) Prioritätsdaten:

196 29 828.8

24. Juli 1996 (24.07.96)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, D-42329 Wuppertal (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52, D-51467 Bergisch Gladbach (DE). MARKERT, Robert [DE/DE]; Silesiusstrasse 82, D-51065 Köln (DE). TIE-MANN, Ralf [DE/DE]; Ernst-Ludwig-Kirchner-Strasse 5, D-51375 Leverkusen (DE). KUHNT, Dietmar [DE/DE]: Eschenallee 6d, D-41399 Burscheid (DE). DUTZMANN, Stefan [DE/DE]; Weissenstein 95, D-40764 Langenfeld (DE). STENZEL, Klaus [DE/DE]; Seesener Strasse 17, D-40595 Düsseldorf (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 15, D-42799 Leichlingen (DE). KUGLER, Martin [DE/DE]; Am Kloster 47, D-42799 Leichlingen

(DE). BUSCHHAUS, Hans-Ulrich [DE/DE]; Bethelstrasse 24, D-47800 Krefeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, ARIPO Patent (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

- (54) Title: CARBANILIDES USED AS PESTICIDES
- (54) Bezeichnung: CARBANILIDE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

$$A - C - NH - A -$$

(57) Abstract

The invention concerns novel carbanilides of formula (I), in which A, Q, R, X, Z and m have the meanings given in the description. The invention further concerns a plurality of processes for preparing these substances, and their use as herbicides and pesticides.

(57) Zusammenfassung

Neue Carbanilide der Formel (I), in welcher A, Q, R, X, Z und m die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von pflanzlichen und tierischen Schädlingen.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
Ai.	Armenien	Fi	Finnland	LT	Litauen	SK .	Slowakei
AM		FR	Prankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AT	Osterreich			LV	Lettland	SZ	Swasiland
AU	Australien	GA	Gabun	MC	Monaco	TD	Tschad
ΑZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich			TG	
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau		Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Medagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland		Republik Mazedonien	TR	Turkei
BG	Bulgarien	HU	Ungaro	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	18	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		Amerika
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI.	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neusceland	zw	Zimbabwe
CM	Kamenin		Korea	PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ.	Kasachatan	RO	Rumanien		
CZ	Tschechische Republik	ic	St. Lucia	RU	Russische Pöderation		
DE	•	ш	Liechtenstein	SD	Sudan		
	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR		SG	Singapur		
EE	Estland	LK	Liberia	30	Anti-		

CARBANILIDE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Carbanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von pflanzlichen und tierischen Schädlingen.

Es ist bereits bekannt, daß zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. WO 93-11 117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, läßt aber in machen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Carbanilide der Formel

$$A - C - NH - R_{m}$$

$$Q-Z$$
(I)

in welcher

R für Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen,
Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen,
Alkoxy mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkylthio mit 1 bis 8
Kohlenstoffatomen, Halogenalkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1
bis 5 Halogenatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8
Kohlenstoffatomen, Carbalkoxy mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen im
Alkoxyteil oder Alkoximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im
Alkoxyteil und 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

m für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

10

15

A für einen Rest der Formel

R¹ für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R² für Wasserstoff, Halogen, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

A für einen Rest der Formel

R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R⁵ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogen steht,

oder

5

10

20

A für einen Rest der Formel

R⁹ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder für Halogenalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15 A für einen Rest der Formel

R¹⁰ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

5 A für einen Rest der Formel

R¹² für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

X¹ für ein Schwefelatom, für SO, SO₂ oder -CH₂ steht,

10 oder

A für einen Rest der Formel

R¹³ für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15 oder

A für einen Rest der Formel

R¹⁴ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht.

- 5 -

oder

5 Α für einen Rest der Formel

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁷ für Wasserstoff, Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen 10 steht,

oder

für einen Rest der Formel Α

15 R¹⁸ für Wasserstoff, Halogen, Amino, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

> R^{19} für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

20 oder

A für einen Rest der Formel

R²⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

5 R²¹ für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

10
$$\mathbb{R}^{22}$$
 \mathbb{R}^{23} steht, world

R²² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

R²³ für Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

15
$$F_5C_2$$
 CF_3 CF_3 CH_3 CH_3

Q für Alkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylen mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylen mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel

5 steht, worin

- R²⁴, R²⁵ und R²⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen stehen, oder
- 10 Q für eine Gruppe der Formel

- R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen stehen,
- Y für ein Sauerstoffatom oder für S(O), steht, wobei
- 15 r für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht, und

n und p unabhängig voneinander für die Zahlen 0, 1 oder 2 stehen,

wobei der durch (*) gekennzeichnete Molekülteil jeweils mit dem Phenylrest des Anilinteiles verbunden ist,

X für Sauerstoff oder Schwefel steht und

Z für gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Naphthyl, gegebenenfalls substituiertes Anthracenyl oder für gegebenenfalls substituiertes Hetaryl steht,

gefunden.

- 5 Weiterhin wurde gefunden, daß man Carbanilide der Formel (I) erhält, wenn man
 - a) Säurehalogenide der Formel

in welcher

A und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

10 Hal für Halogen steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel

$$H_2N \xrightarrow{R_m}$$
 (III)

in welcher

Q, R, Z und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

b) Carbanilid-Derivate der Formel

$$\begin{array}{c} X \\ | \\ A-C-NH \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} R_m \\ \end{array}$$
 (IV)

in welcher

A, R, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5 X² für Sauerstoff oder Schwefel steht,

mit Verbindungen der Formel

$$\begin{array}{ccc}
E-(CH)_p-Z \\
\downarrow \\
R^{28}
\end{array} (V)$$

in welcher

R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

10 E für eine Austrittsgruppe steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

c) Carbanilid-Derivate der Formel

$$\begin{array}{c} X \\ II \\ A-C-NH \end{array} \qquad \begin{array}{c} R_m \\ \\ HC-E^1 \\ R^{27} \end{array} \qquad (VI)$$

in welcher

A, R, R²⁷, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

E¹ für eine Austrittsgruppe steht,

mit Verbindungen der Formel

$$H-X^3-(CH)_p-Z$$

$$\downarrow^{R^{28}}$$
(VII)

in welcher

5 R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X³ für Sauerstoff oder Schwefel steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

d) Carbanilid-Derivate der Formel

10

in welcher

A, R, R²⁷, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Verbindungen der Formel

$$\begin{array}{ccc}
E-(CH)_p-Z \\
I \\
R^{28}
\end{array} (V)$$

in welcher

R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

E für eine Austrittsgruppe steht.

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

e) Carbanilid-Derivate der Formel

$$A-C-NH \xrightarrow{X} R_m$$

$$O=C$$

$$R^{26}$$
(IX)

in welcher

A, R, R²⁶, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydroxylamin-Derivaten der Formel

$$H_2N-O-Z$$
 (X)

in welcher

5

15

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, daß die neuen Carbanilide der Formel (I) sehr gut als Schädlingsbekämpfungsmittel verwendbar sind. Sie besitzen mikrobizide Eigenschaften und können zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz eingesetzt werden. Außerdem eignen sie sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen.

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen Carbanilide der Formel (I) eine wesentlich bessere fungizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Carboxamide gleicher Wirkungsrichtung.

10

Die erfindungsgemäßen Carbanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

R steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Alkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Carbalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil oder für Alkoximinoalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

m steht vorzugsweise für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3, wobei R für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn m für 2 oder 3 steht.

15 A steht vorzugsweise für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^{1}$$
 \mathbb{N}
 \mathbb{R}^{2}
, worin
 $\mathbb{C}H_{3}$

R¹ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Isopropyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht und

20 R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Ethyl steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

WU 20/U25UU PU1/EP9//U3094

- 13 -

R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen und

R⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl oder Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^{6}$$
 , woring

5

10

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen und

R⁸ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

15 R⁹ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5
Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2
Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen
oder für Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis
5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

10

15

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

$$R^{11}$$
 N R^{10} , worin

R¹⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio oder für Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht und

R¹¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio oder für Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

$$X^1$$
, woring

R¹² für Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht und

X¹ für ein Schwefelatom, für SO, SO₂ oder -CH₂- steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

R¹³ für Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl, mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

R¹⁴ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

10 R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen und

R¹⁷ für Wasserstoff, Fluor, Chior, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

R¹⁸ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Cyano, Methyl oder Ethyl steht und

R¹⁹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

R²⁰ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Cyano, Methyl oder Ethyl steht und

R²¹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht.

A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

R²² für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht und

R²³ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

15 A steht außerdem vorzugsweise für einen Rest der Formel

W い フロバンンいい

Q steht vorzugsweise für Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, Alkenylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, Alkinylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel

- R²⁴, R²⁵ und R²⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Alkenyl mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder Alkinyl mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen stehen.
 - Q steht außerdem vorzugsweise für eine Gruppe der Formel

10
$$\begin{array}{c|c} -^{+}(CH)_{n}^{-}Y^{-}(CH)_{p}^{-} \\ \downarrow & \downarrow \\ R^{27} & R^{28} \end{array}$$
 , worin

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,

- Y für ein Sauerstoffatom oder für S(O)_r steht, wobei
 - r für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht, und
- n und p unabhängig voneinander für die Zahlen 0, 1 oder 2 stehen, wobei der durch (*) gekennzeichnete Molekülteil jeweils mit dem Phenylrest des Anilinteiles verbunden ist.
 - X steht auch vorzugsweise für Sauerstoff oder Schwefel.
- zo steht vorzugsweise für Phenyl, Naphthyl oder Anthracenyl, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Phenyl und/oder Phenoxy.

- z steht außerdem vorzugsweise für Hetaryl mit 5 oder 6 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Sauerstoff, Schwefel und/oder Stickstoff, wobei jeder der Heterocyclen einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Phenyl und/oder Phenoxy.
- 10 R steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, sek.-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethylthio, Allyloxy, Propargyloxy, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl.
 - m steht besonders bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3, wobei R für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn m für 2 oder 3 steht.
 - A steht besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

20
$$\mathbb{R}^1$$
 \mathbb{R}^2 , woring \mathbb{R}^2

- R¹ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht und
- R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Ethyl steht.
- 25 A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^3$$
 \mathbb{R}^5 , woring

R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl stehen und

5 R⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^6$$
 , woring

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl stehen und

R⁸ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

15 R⁹ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, i-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio steht.

10

15

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$R^{11}$$
 N R^{10} , woring

R¹⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, i-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Trichlormethoxy steht und

R¹¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, i-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$X^1$$
, worin

R¹² für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht und

X¹ für ein Schwefelatom, für SO, SO₂ oder -CH₂- steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

20 R¹³ für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht. A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

R¹⁴ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht.

5 A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^{16}$$
 , worin

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl stehen und

10 R¹⁷ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

R¹⁸ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Cyano, Methyl oder Ethyl steht und

15 R¹⁹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^{20}$$
 \mathbb{R}^{21} , worin

R²⁰ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Cyano, Methyl oder Ethyl steht und

R²¹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht.

A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

$$\mathbb{R}^{22}$$
 \mathbb{N} , worin

R²² für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht und

R²³ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht.

10 A steht außerdem besonders bevorzugt für einen Rest der Formel

Q steht besonders bevorzugt für Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, Alkenylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, Alkinylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel

R²⁴, R²⁵ und R²⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Allyl oder Propargyl stehen.

15

Q steht außerdem besonders bevorzugt für eine Gruppe der Formel

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,

Y für ein Sauerstoffatom oder für S(O), steht, wobei

r für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht, und

n und p unabhängig voneinander für die Zahlen 0, 1 oder 2 stehen, wobei der durch (*) gekennzeichnete Molekülteil jeweils mit dem Phenylrest des Anilinteiles verbunden ist.

- 10 X steht auch besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
 - steht besonders bevorzugt für Phenyl, Naphthyl oder Anthracenyl, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, sek.-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Phenyl und/oder Phenoxy
- z steht außerdem besonders bevorzugt für Pyrrolyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-Triazinyl, 1,3,5-Triazinyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Pyrazinyl oder Pyridazinyl, wobei jeder dieser Reste einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, sek.-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Phenyl und/oder Phenoxy.

WO 98/03500 PCT/EP97/03694

Verwendet man 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäurechlorid und 2-(2-Phenylethen-1-yl)-anilin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

Verwendet man 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-(2-hydroxy)anilid und 2,4-Dimethyl-benzylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

$$F_{3}C \xrightarrow{C} C-NH \xrightarrow{C} + CI-CH_{2} \xrightarrow{CH_{3}} CH_{3} \xrightarrow{HCI} F_{3}C \xrightarrow{C} C-NH \xrightarrow{C} CH_{3} \xrightarrow{C} CH_{3}$$

Verwendet man 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-(2-brommethyl)anilid und 4-Chlor-thiophenol als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

$$F_{3}C \xrightarrow[C+N]{O} CH_{2}Br + HS \xrightarrow{-C} CI \xrightarrow{-HBr} F_{3}C \xrightarrow[C+N]{O} CH_{2}-S \xrightarrow{-C} CI$$

Verwendet man 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-(2-hydroxymethyl)-anilid und 2,4-Dimethylbenzylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

10

15

20

Verwendet man 1-Methyl-3-trifluormethylpyrazol-4-carbonsäure-(2-methyl-carbonyl)-anilid und O-Phenyl-hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel haben A und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Hal steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom.

Die Säurehalogenide der Formel (II) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. WO 93-11 117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Reaktionskomponenten benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben Q, R, Z und m vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden.

Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. WO 93-11 117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 371 950 und EP-A 0 292 990).

10

15

20

25

30

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Es ist jedoch auch möglich, ohne zusätzliches Säurebindemittel zu arbeiten, oder die Aminkomponente in einem Überschuß einzusetzen, so daß sie gleichzeitig als Säurebindemittel fungiert.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlo

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

Sowohl bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als auch der erfindungsgemäßen Verfahren (b) bis (e) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 Mol an Säurehalogenid der Formel (II) im allgemeinen 1 Mol oder auch einen Überschuß an Anilin-Derivat der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das Reaktionsgemisch mit Wasser versetzt, die organische Phase abtrennt und nach dem Trocknen unter vermindertem Druck einengt. Der verbleibende Rückstand kann gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Carbanilid-Derivate sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel haben A, R, X und m vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden. X² steht auch vorzugsweise für Sauerstoff oder Schwefel.

Die Carbanilid-Derivate der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen. So erhält man Verbindungen der Formel (IV), wenn man Säurehalogenide der Formel

in welcher

5

10

15

A, X und Hal die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Amino-phenolen bzw. Aminothiophenolen der Formel

$$H_2N$$
 R_m
 (XI)

25 in welcher

10

15

R, X² und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels, wie z.B. Kaliumcarbonat oder eines tertiären Amins, sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines inerten organischen Verdünnungsmittels, wie z.B. Toluol, bei Temperaturen zwischen 20°C und 150°C umsetzt.

Die bei der Durchführung des obigen Verfahrens als Reaktionskomponenten benötigten Amino-phenole bzw. Aminothiophenole der Formel (XI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Reaktionskomponenten benötigten Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein
definiert. In dieser Formel haben R²⁸, Z und p vorzugsweise diejenigen
Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der
erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen
Index genannt wurden. E steht vorzugsweise für Chlor, Brom, Iod,
Methylsulfonyloxy, Tolylsulfonyloxy oder einen Rest der Formel R²⁹-O-SO₂-Ooder R²⁹-O-CO-O-, worin R²⁹ für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, vorzugsweise für Methyl oder Ethyl steht.

Die Verbindungen der Formel (V) sind ebenfalls bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Natriumhydrogencarbonat, ferner Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat oder Ammoniumcarbonat, und außerdem tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylaminopyridin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin,

10

15

20

Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Verdünnungsmittel, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) vorzugsweise genannt wurden.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen -10°C und +120°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man auf 1 Mol an Carbanilid-Derivat der Formel (IV) im allgemeinen 1 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (V) sowie gegebenenfalls eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das Reaktionsgemisch mit Wasser versetzt, die organische Phase abtrennt und nach dem, Trocknen unter vermindertem Druck einengt. Verwendet man bei der Durchführung der Umsetzung ein mit Wasser mischbares Solvens, so fällt das gewünschte Produkt beim Verdünnen des Reaktionsgemisches mit Wasser im allgemeinen als Feststoff an. In diesem Fall erfolgt die Isolierung in der Regel durch einfaches Absaugen. Das jeweils erhaltene Produkt kann gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Carbanilid-Derivate sind durch die Vormel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel haben A, R, R²⁷, X und m vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden. E¹ steht vorzugsweise für Chlor, Brom, Iod, Methylsulfonyloxy, Tolylsulfonyloxy oder einen Rest der Formel R²⁹-O-SO₂-O-oder R²⁹-O-CO-O- worin R²⁹ für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, vorzugsweise für Methyl oder Ethyl steht.

15

20

25

30

Die Carbanilid-Derivate der Formel (VI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Reaktionskomponenten benötigten Verbindungen sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel haben R²⁸, Z und p vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden. X³ steht auch vorzugsweise für Sauerstoff oder Schwefel.

Die Verbindungen der Formel (VIII) sind ebenfalls bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Säureakzeptoren, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) vorzugsweise genannt wurden.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) Wasser sowie alle üblichen inerten, organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykol-dimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propynol, Ethylenglykol-monomethylether, Ethylenglykol-monoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im

10

15

20

25

allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen -10°C und +120°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) setzt man auf 1 Mol an Carbanilid-Derivat der Formel (VI) im allgemeinen 1 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (VII) sowie gegebenenfalls eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Carbanilid-Derivate sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel haben A, R, R²⁷, X und m vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden.

Die Carbanilid-Derivate der Formel (VIII) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Säureakzeptoren, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) vorzugsweise genannt wurden.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Verdünnungsmittel, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) vorzugsweise genannt wurden.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen -10°C und +120°C.

10

15

20

25

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) setzt man auf 1 Mol an Carbanilid-Derivat der Formel (VIII) im allgemeinen 1 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (V) sowie gegebenenfalls eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Carbanilid-Derivate sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel haben A, R, R²⁶, X und m vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste bzw. diesen Index genannt wurden.

Die Carbanilid-Derivate der Formel (IX) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens als Reaktionskomponenten benötigten Hydroxylamin-Derivate sind durch die Formel (X) allgemein definiert. In dieser Formel hat Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diesen Rest genannt wurden.

Die Hydroxylamin-Derivate der Formel (X) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) alle für derartige Umsetzungen üblichen sauren Reaktionsbeschleuniger in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Chlorwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Trifluormethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Bortrifluorid (auch als Etherat), Bortribromid, Aluminiumtrichlorid, Titantetrachlorid, Tetrabutylorthotitanat, Zinkchlorid, Eisen-III-chlorid, Antimonpentachlorid, saure Ionenaustauscher, saure Tonerden und saures Kieselgel.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen
Verfahrens (e) alle für derartige Umsetzungen üblichen inerten, organischen
Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische

25

oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; außerdem halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan und auch Nitrile, wie n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 120°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) setzt man auf 1 Mol an Carbanilid-Derivat der Formel (IX) im allgemeinen 1 bis 2 Mol an Hydroxylamin-Derivat der Formel (X) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae; Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans; Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora; Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

5 Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

- 15 Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
 - Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

20 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

- 25 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
 - Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia-, Podosphaera-, Phytophtora- und Plasmopara-Arten, einsetzen. Mit gutem Erfolg werden auch Reiskrankheiten, wie beispielsweise Pyricularia-Arten, bekämpft.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

25 Alternaria, wie Alternaria tenuis, Aspergillus, wie Aspergillus niger, Chaetomium, wie Chaetomium globosum, Coniophora, wie Coniophora puetana, Lentinus, wie Lentinus tigrinus, 30 Penicillium, wie Penicillium glaucum, Polyporus, wie Polyporus versicolor, Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,

5

10

15

20

Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
Trichoderma, wie Trichoderma viride,
Escherichia, wie Escherichia coli,
Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

WO 98/03500

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Gartenbau, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor bzw. im veterinärmedizinischen Bereich vorkommen. Die Stoffe sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen Schädlinge in allen oder einzelnen Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten tierischen Schädlingen gehören:

- 36 -

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus. Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spec.

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp...

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp.

WU 98/03300 PCT/EP9//03094

- 37 -

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trichodectes spp., Damalinea spp.

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Spodoptera exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana.

15

20

25

30

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.

15

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp.

10 Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp.

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp.

- Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.
- Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfs-

10

15

20

lösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methyleton, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.
- Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

10 Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticdin-S, Bromuconazol, Bupirimat,

- 15 Buthiobat,
 - Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat(Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,
- Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
 - Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol,
- Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilate, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid. Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

10 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos,

15 Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Quinconazol, Quintozen (PCNB),

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-

20 methyl, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

25 Dagger G,

5

OK-8705,

OK-8801.

2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5carboxanilid,

- 30 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 - 2-Aminobutan.
 - 2-Phenylphenol(OPP),
 - 8-Hydroxychinolinsulfat,
 - cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol.
- 35 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon. α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

- 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
- bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
- 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
- (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
- 5 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 - O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
 - N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 - 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
 - N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
- cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,
 - 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 - 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 - 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
- 15 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 - 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 - N-[3-Chlor-4,5-bis(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 - α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol.
- 20 l-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 - N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 - 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 - N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 - N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin-Natriumsalz,
- N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 - 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on.
 - 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
 - Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 - N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 - Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 - 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin.
 - 2-[(1-Methylethyl)sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol
 - spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on.
- Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat, Kaliumhydrogencarbonat,
 - 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,

ママレックロンごせい

- 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
- 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril.

- 43 -

- Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat, 5 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid, O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat, α-(2,4-Dichlorphenyl)-β-fluor-β-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 - 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
- 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat, 10
 - S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat
 - N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
 - 3,5-Dichlor-N-[cyan-[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 - 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
- 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin, 15 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid, N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.

Bakterizide:

20

25

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, AC 303 630, Acephat, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus thuringiensis, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Betacyluthrin, Bifenthrin, BPMC, Brofenprox, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butocarboxim, Butylpyridaben.

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA 157 419, CGA 184699, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlor-30 fluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Cis-Resmethrin, Clocythrin, Clofentezin, Cyanophos, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazin,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicliphos, Dicrotophos, Diethion, Diflubenzuron, Dimethoat,

Dimethylvinphos, Dioxathion, Disulfoton,

Edifenphos, Emamectin, Esfenvalerat, Ethiofencarb, Ethion, Ethofenprox, Ethoprophos, Etrimphos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatinoxid, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyroximat, Fenthion, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Flucycloxuron, Flucythrinat, Flufenoxuron, Flufenprox,

10 Fluvalinate, Fonophos, Formothion, Fosthiazat, Fubfenprox, Furathiocarb,

HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox,

Imidacloprid, Iprobenfos, Isazophos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Lambda-cyhalothrin, Lufenuron,

Malathion, Mecarbam, Mevinphos, Mesulfenphos, Metaldehyd, Methacrifos,

Methamidophos, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Milbemectin, Monocrotophos, Moxidectin,

Naled, NC 184, NI 25, Nitenpyram

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M, Oxydeprofos,

Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalon, Phosmet,

Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos M, Pirimiphos A, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozin, Pyrachlophos, Pyridaphenthion, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyrimidifen, Pyriproxifen, Quinalphos,

RH 5992,

- Salithion, Sebufos, Silafluofen, Sulfotep, Sulprofos,
 Tebufenozid, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin,
 Temephos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiafenox, Thiodicarb, Thiofanox, Thiomethon, Thionazin, Thuringiensin, Tralomethrin, Triarathen, Triazophos, Triazuron, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,
- Vamidothion, XMC, Xylylcarb, Zetamethrin.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen,

35 Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet

.. - ------

5

20

25

30

werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Versprützen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Bei der Behandlung von Pflanzenteilen können die Wirkstoffkonzentrationen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden: Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001 Gew.-%.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g benötigt.

Bei der Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen von 0,00001 bis 0,1 Gew.-%, vorzugsweise von 0,0001 bis 0,02 Gew.-% am Wirkungsort erforderlich.

Die zum Schutz technischer Materialien verwendeten Mittel enthalten die Wirkstoffe im allgemeinen in einer Menge von 1 bis 95%, bevorzugt von 10 bis 75 %.

Die Anwendungskonzentrationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe richten sich nach der Art und dem Vorkommen der zu bekämpfenden Mikroorganismen sowie nach der Zusammensetzung des zu schützenden Materials. Die optimale Einsatzmenge kann durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen liegen die Anwendungskonzentrationen im Bereich von 0,001 bis 5 Gewichts-%, vorzugsweise von 0,05 bis 1,0 Gewichts-% bezogen auf das zu schützende Material.

Die Wirksamkeit und das Wirkungsspektrum der erfindungsgemäß im Materialschutz zu verwendenden Wirkstoffe bzw. der daraus herstellbaren Mittel, Konzentrate oder ganz allgemein Formulierungen kann erhöht werden, wenn gegebenenfalls weitere antimikrobiell wirksame Verbindungen, Fungizide, Bakterizide,
Herbizide, Insektizide oder andere Wirkstoffe zur Vergrößerung des Wirkungsspektrums oder Erzielung besonderer Effekte wie z.B. dem zusätzlichen Schutz vor
Insekten zugesetzt werden. Diese Mischungen können ein breiteres Wirkungsspektrum besitzen als die erfindungsgemäßen Verbindungen.

Auch beim Einsatz gegen tierische Schädlinge können die erfindungsgemäßen Stoffe in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

PC 1/EPY //U3094

<u>Herstellungsbeispiele</u>

Beispiel 1

Verfahren (a):

5

10

15

Eine Lösung von 0,3 g (0,0015 Mol) 2-(2-Phenyl-ethen-1-yl)-anilin in 2 ml Toluol wird bei Raumtemperatur mit einer Lösung von 0,15 g (0,0015 Mol) Triethylamin in 10 ml Toluol versetzt. In dieses Gemisch werden bei Raumtemperatur unter Rühren 0,33 g (0,0015 Mol) 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäurechlorid gegeben. Anschließend erwärmt man auf 50°C und läßt 2 Stunden bei dieser Temperatur nachrühren. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch dann auf Raumtemperatur abgekühlt und mit Wasser versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und danach bei 60°C unter vermindertem Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Diethylether als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates erhält man 0,53 g (95 % der Theorie) an 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäure-[2-(2-phenyl-ethen-1-yl)]-anilid in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 80 bis 82°C.

Herstellung von Ausgangssubstanzen:

Ein Gemisch aus 4,2 g (0,022 Mol) 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäure in 45 ml Toluol wird bei 80°C unter Rühren mit 3,1 g (0,026 Mol) Thionylchlorid

10

15

20

25

versetzt. Nach beendeter Zugabe wird das Reaktionsgemisch auf 90°C erhitzt und noch 2 Stunden bei dieser Temperatur gerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck bei 60°C eingeengt. Man erhält auf diese Weise 4,6 g (98,3 % der Theorie) an 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäurechlorid in Form eines Öles.

Ein Gemisch aus 2,4 g (0,012 Mol) 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäure-methylester und 5 ml Ethanol wird bei Raumtemperatur mit einer Lösung von 2 g (0,048 Mol) Natriumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt und dann 10 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit 50 ml Wasser verdünnt und mehrfach mit Methylenchlorid extrahiert. Die wäßrige Phase wird durch Zugabe von verdünnter Salzsäure auf einen pH-Wert von 2 bis 3 gebracht. Das anfallende Festprodukt wird abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 2,2 g (90,15 % der Theorie) an 3-Difluormethoxythiophen-2-carbonsäure in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 98 bis 100°C.

Ein Gemisch aus 10 g (0,063 Mol) 3-Hydroxy-thiophen-2-carbonsäure-methylester und 90 ml Toluol wird bei Raumtemperatur mit einer Lösung von 5,1 g (0,127 Mol) Natriumhydroxid in 8 ml Wasser versetzt. Man erwärmt das Reaktionsgemisch unter Rühren auf 90°C, gibt 1,1 g Tetrabutyl-phosphoniumbromid hinzu und leitet innerhalb von 30 Minuten 16,4 g (0,189 Mol) Chlordifluormethan ein. Danach wird eine Stunde bei 90°C nachgerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch auf Raumtemperatur abgekühlt und mit Wasser versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und dann bei 50°C unter vermindertem Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Cyclohexan: Essigsäureethylester = 3:1 als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates erhält

10

15

25

man 4,1 g (31,3 % der Theorie) an 3-Difluormethoxy-thiophen-2-carbonsäuremethylester in Form eines Öles.

¹H-NMR-Spektrum (CDCl₃/TMS): $\delta = 3,833$ (s, 3H); 7,463/7,481 (d, 1H) ppm

Ein Gemisch aus 12,9 g (0,057 Mol) 1-Phenyl-2-(2-nitro-phenyl)-ethen und 210 ml 17 %iger wäßriger Salzsäure wird bei Raumtemperatur mit 38,7 g Zinnpulver versetzt und langsam auf Rückflußtemperatur erhitzt. Man kocht 2 Stunden unter Rückfluß, kühlt dann auf Raumtemperatur ab und extrahiert mehrfach mit Diethylether. Die organische Phase wird unter vermindertem Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Wasser versetzt, und das entstehende Gemisch wird durch Zugabe von verdünnter wäßriger Natronlauge neutral gestellt und dann mehrfach mit Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und anschließend unter vermindertem Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Cyclohexan: Essigsäureethylester = 3:1 an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates erhält man 8,5 g (76,4 % der Theorie) an 2-(2-Phenylethen-1-yl)-anilin in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 80°C.

Beispiel 2

20 Verfahren (b):

Ein Gemisch aus 1,0 g (0,0035 Mol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbon-säure-(2-hydroxymethyl)-anilid, 0,53 g (0,0039 Mol) Kaliumcarbonat und 10 ml Acetonitril wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit 0,57 g (0,0037 Mol) 2,4-Dimethyl-benzylchlorid versetzt. Nach der Zugabe erwärmt man auf 60°C und rührt 2 Stunden bei dieser Temperatur. Anschließend wird das Reaktionsgemisch

10

15

20

auf Raumtemperatur abgekühlt und mit Wasser versetzt. Der anfallende Niederschlag wird abgesaugt, mit Wasser gewaschen und bei 50°C unter vermindertem Druck über Phosphorpentoxid getrocknet. Man erhält auf diese Weise 1,2 g (85 % der Theorie) an 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-[2-(2,4-dimethylbenzyloxy)]-anilid als Festsubstanz vom Schmelzpunkt 123 bis 125°C. 1 H-NMR-Spektrum (CDCl₃/TMS): $\delta = 3,945$ (s, 3H); 5,082 (s, 2H) ppm

Herstellung der Ausgangssubstanz:

Ein Gemisch aus 2,4 g (0,022 Mol) 2-Amino-phenol und 80 ml Toluol wird bei 100°C unter Rühren mit einer Lösung von 5,0 g (0,024 Mol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäurechlorid in 25 ml Toluol versetzt. Das Reaktionsgemisch wird weitere 4 Stunden bei 100°C gerührt, dann auf Raumtemperatur abgekühlt und mit Wasser versetzt. Der anfallende Niederschlag wird abgesaugt und bei 50°C unter vermindertem Druck getrocknet. Man erhält auf diese Weise 5,4 g (86,1 % der Theorie) an 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-(2-hydroxymethyl)-anilid in Form einer Festsubstanz vom Schmelz-punkt 191°C.

¹H-NMR-Spektrum (d6-DMSO/TMS): $\delta = 3,972$ (s, 3H)

Beispiel 3

Verfahren (b):

Eine Lösung von 3 g (10,5 mmol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbon-säure-(2-hydroxymethyl)-anilid in 15 ml Dimethylformamid wird bei 15°C unter Rühren langsam mit 0,347 mg Natriumhydrid (80 %ig in Paraffin) versetzt. Anschließend wird diese Mischung bei 0°C unter Rühren in eine Lösung von 1,41 g (10,5 mmol) 4,5,6-Trifluorpyrimidin in 15 ml Dimethylformamid eingetropft. Nach beendeter Zugabe wird das Reaktionsgemisch noch 1 Stunde bei 0°C nachgerührt und dann durch Abziehen des Lösungsmittels unter vermindertem Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Wasser versetzt und 2 Minuten intensiv gerührt. Das anfallende Festprodukt wird abgesaugt, getrocknet und aus Toluol umkristallisiert. Man erhält auf diese Weise 3,43 g (81 % der Theorie) an 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-4-carbonsäure-[2-(4,5-difluor-pyrimidyl-6-oxy)]-anilid in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 197°C.

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle I aufgeführten Carbanilide der Formel

erhalten.

5

10

Tabelle 1

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
4	CI	О	-CH=CH-	-(_)	-	Fp. 154-156°C
5	F ₃ C N S CH ₃	Ο	-CH=CH-	-(_)	-	Fp. 144-146°C
6	CF ₃	0	-SO ₂ -		-	Fp. 97°C
7	E Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	0	-\$0 ₂ -		•	1 H-NMR** $\delta = 2,55 (3H)$
8	CF ₃	0	0		-	Fp. 68°C
9	H ₃ , Z-H ₃	0	Ο		•	¹ H-NMR** δ = 2,44 (3H) 3,82 (3H)

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	x	Q	Z	R _m	physik. Konstante
10	F ₃ C N S CH ₃	0	0	→	-	1 H-NMR** $\delta = 2,73 (3H)$
11	F ₃ C N S CH ₃	0	SO ₂	—	-	Fp. 94°C
12	F ₃ C N CH ₃	0	0		•	Fp. 95°C
13	F ₃ C = N - H ₃	0	SO ₂		-	Fp. 119°C
14	CH ₃	0	0		-	Öl

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
15	Br	0	-СН=СН-		•	Öl .
16	F ₃ Z-U	c	-CH=CH-		•	Fp. 117°C
17	F ₃ C Z-U	0	-СН=СН-		-	Fp. 208°C
18	C Z-G	0	-СН≃СН-		•	Fp. 123°C
19	CF ₃	0	-CH=CH•			Fp. 161°C
20	F ₂ HC N CH ₃	0	-CH=CH-		-	Fp. 1 22° C

Tabelle 1 - Fortsetzung

		-			_	
Bsp. Nr.	A	Х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
21	F ₂ HC	0	0	——————————————————————————————————————	-	Fp. 110-112°C
22	CIF ₂ C	0	-CH=CH-		-	Fp. 158°C
23	S CH ₃	О	-CH=CH-		-	1 H-NMR** $\delta = 2,30 (3H)$
24	SO ₂ CH ₃	0	-CH=CH-		-	1 H-NMR** $\delta = 2,04 (3H)$
25	SO CH ₃	0	-CH=CH-	-	-	¹ H-NMR** δ = 2,40 (3H)
26	F ₃ C N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 113-115°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	А	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
27	F ₃ C	0	-*O-CH ₂ -		-	Fp. 108°C
28	F ₃ C N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	•	Fp. 123-125°C
29	O CF ₃	O	-CH=CH-		•	Fp. 177°C
30	F ₃ C Z-H ₃	0	-*O-CH₂-	~ cı	•	Fp. 123-126°C
31	F ₃ C S CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	•	Fp. 90-92°C

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

r-	T T					
Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
32	F ₃ C N S CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 83-85°C
33	F ₃ C N S CH ₃	0	-*О-СН ₂ -		-	Fp. 105-107°С
34	F ₃ C N S CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	•	Fp. 89-91°C
35	F ₃ C S CH ₃	0	-*O-CH ₂ -		-	Fp. 158-161°C
36	F ₂ HC	0	-*CH ₂ -S-	-	-	¹ H-NMR** δ = 3,88 (3H); 4,12 (2H)

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
37	F ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -S-		-	Fp. 105°C
38	H ₃ Z - H ₃	0	-*CH ₂ -S-		-	Fp. 78°C
39	H ₃ C CI CH ₃	O	-*CH ₂ -S-		•	Fp. 131°C
40	F ₃ C S CH ₃	0	-*CH ₂ -S-		-	Fp. 97°C
41	CI	О	-*CH ₂ -S-	→	-	Fp. 99°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

	T T	<u> </u>	T	<u> </u>		
Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
42	H ₃ C CH ₃	0	-*CH ₂ -S-	— <u>(</u>)—сн ₃	-	Fp. 94°C
43	F ₃ C IIII	0	-*CH ₂ -S-	— <u>—</u> СН ₃	-	Fp. 135°C
44	F ₃ C S CH ₃	Ο	-*CH ₂ -S-	——СН3	-	Fp. 118°C
45	H ₃ C CI CH ₃	О	-*CH ₂ -S-	— ()—сн _з	<u>-</u>	Fp. 161°C
46	F ₂ HC	0	-*CH ₂ -S-	——СН ₃	-	Fp. 108°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
47	N CI	O	-*O-CH ₂ -	СН ³	-	Fp. 73-75°C
48	CI	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 98-100°C
49	C C	O	-*O-CH ₂ -	~	-	Fp. 88-90°C
50	F ₂ HC N CH ₃	О	-*CH ₂ -O-	сн,	-	Fp. 120°C
51	H ₃ C	0	-*CH ₂ -O-	сн,	•	Fp. 112°C
52	F ₃ C N CH ₃	0	-*СН ₂ -О-	СН3	-	Fp. 153°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

						
Bsp. Nr.	A	, X	Q	Z	R _m	physik. Konstante
53	F ₃ C N S CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	—————————————————————————————————————	-	Fp. 167°C
54	CI	0	-*CH ₂ -S-	~	•	Fp. 108°C
\$5	CI CI	О	-*CH ₂ -S-	— Сн,	-	Fp. 131°C
\$6	CI	0	-*O-CH₂-	CH ₃	-	Fp. 104-106°C
57	CI CI	0	-*O-CH ₂ -	-CI	•	Fp. 130-133°C
58	CF ₃	О	-*СН ₂ -S-		•	Fp. 133°C
59	CF ₃	0	-*CH ₂ -S-	———сн,	-	Fp. 133°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	А	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
60	H ₃ C CI	0	-*CH ₂ -O-	СН,	•	Fp. 153°C
61	CH ₃	0	-*CH ₂ -S-	— СН,	•	Fp. 112°C
62	F ₃ C Z-CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	2	-	Fp. 129-131°С
63	F ₃ C N CH ₃	O	-*O-CH ₂ -	CI	•	Fp. 137-138°C
64	F ₃ C N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	-CI	•	Fp. 128-130°C
65	CH ₃	0	-*CH ₂ -S-		•	¹ H-NMR** δ = 2,29 (3H); 4,09 (2H)

Tabelle 1 - Fortsetzung

		T	1	T		
Bsp. Nr.	A	X	Q	Z	R _m	physik. Konstante
66	F ₃ C	О	-*O-CH ₂ -	CN	-	Fp. 118-120°C
67	F ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CN CN	-	Fp. 158-159°C
68	Ç C	0	-*O-CH ₂ -	CI	-	Fp. 98-100°C
69	CI	0	-*O-CH ₂ -	CI	-	Fp. 112-114°C
70	O CF3	0	-*СН ₂ -О-	————сн, сн,	•	Fp. 149°C
71	S CH3	Ο	-*O-CH ₂ -	CH ₃	•	1 H-NMR** $\delta = 2,15 (3H)$

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

Bsp. Nr.	۸	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
72	S CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	— СН,	-	Fp. 118°C
73	CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	√ o	-	Fp. 122°C
74	CH ₃	О	-*O-CH ₂ -		-	1 H-NMR** $\delta = 2,25 (3H)$
75	CI	O	-*O-CH ₂ -	—CI	-	Fp. 110°C
76	CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	•	Fp. 76°C
77	CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CI	-	Fp. 135°C

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
78	CH ₃	О	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 94°C
79	F ₂ HC	0	-*CH ₂ -S-	-CI	•	¹ H-NMR** δ = 3,89 (3H) 4,08 (2H)
80	CF ₃	0	-*CH ₂ -S-	————cı	-	Fp. 169°C
81	O-Z, O	0	-*CH ₂ -S-	———ci	-	Fp. 119°C
82	S CF ₃	0	-*CH ₂ -S-	-CI	•	Fp. 155°C
83	F ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -S-	———cı	-	Fp. 115°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
84	H ₃ C N N CI CH ₃	0	·*CH ₂ -S-	-CI	-	Fp. 97°C
85	F ₃ C N S CH ₃	О	-*CH ₂ -S-	-CI	-	Fp. 112°C
86	CI	0	-*O-CH ₂ -	CN	-	Fp. 140°C
87	CI	O	-*O-CH ₂ -	CN	•	Fp. 115-118°C
88	Ci	0	-*O-CH ₂ -	—()—cn	•	Fp. 165-168°C
89	F ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	————cn	-	Fp. 182-184°C

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
90	S CH ₃	0	-*CH ₂ -S-	-CI	-	Fp. 116°C
91	F ₃ C N N CH ₃	O	•*СН ₂ -SO-	— С	-	Fp. 182°C
92	H ₃ C N N CH ₃	O	-*CH ₂ -SO-	—Сн,	-	Fp. 165°C
93	F ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -SO-		-	Fp. 147°C
94	H ₃ C CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	———cn	-	Fp. 137°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp.	А	х	Q	Z	R _m	physik.
95	H ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Konstante Fp. 76-78°C
96	H ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 130-132°C
97	H ₃ C N N - CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 113-115°C
98	H ₃ C N N CH ₃	О	-*O-CH ₂ -		-	Fp. 118°C
99	H ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	—CI	-	Fp. 95°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	x	Q	Z	R _m	physik. Konstante
100	H ₃ C N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	cı	•	Fp. 81-82°C
101	S CH3	О	-*0-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 95°C
102	H ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	Co	-	Fp. 124°C
103	H ₃ C N N-CH ₃	O	-*O-CH ₂ -	———cı	-	Fp. 149-150°C
104	H ₃ C CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	-CN	-	Fp. 60-62°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	А	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
105	F ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -SO ₂ -	—Сн,	-	Fp. 211°C
106	H ₃ C N-CH ₃	0	-*CH ₂ -SO ₂ -	———сн,	-	Fp. 162°C
107	F ₃ C N N CH ₃	О	-*CH ₂ -SO ₂ -		•	¹ H-NMR** δ = 3,93 (3H); 4,36 (2H)
108	H ₃ C N-CH ₃	0	-*CH ₂ -SO ₂ -	—	-	Fp. 165°C
109	H ₃ C N N - CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CX	-	Fp. 166-168°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
110	H ₃ C N N CH ₃	О	-*O-CH ₂ -	———cn		Fp. 157-158°C
111	H ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 92°C
112	F ₃ C N N CH ₃	0	-*O-CH ₂ -	CH ₃	-	Fp. 108°C
113	CI	O	-*O-CH ₂ -	—⟨⟩CH₃	•	Fp. 118-120°C
114	S Br	0	0		•	¹ H-NMR** δ = 9,61 (1H, s)

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
115	H ₃ C N N C N C H ₃ C	0	-*CH ₂ -O-	—	-	¹ H-NMR** δ = 5,10 (2H, s)
116	F ₃ C N N - CH	0	•*CH ₂ -O-	—	-	¹ H-NMR** δ = 5,07 (1H, s)
117	S CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	————cн ₃	_	¹ H-NMR** δ = 2,29 (3H, s)
118	F ₃ C N N - CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	——СH ₃	•	¹ H-NMR** δ = 2,30 (3H)
119	F ₂ HC N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	——СH ₃	-	l H-NMR** $\delta = 3,83 (3H)$

Tabelle 1 - Fortsetzung

()————————————————————————————————————		_		the same and the s		
Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
120	H ₃ C N N CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	— СН 3	-	¹ H-NMR** δ = 3,66 (3H)
121	CI	0	-*CH ₂ -O-	—Сн,	•	¹ H-NMR** δ = 5,10 (2H)
122	F ₃ C N S CH ₃	0	- * CH ₂ -O-	—Сн,	-	1 H-NMR** $\delta = 2,73 (3H)$
123	F ₂ HC N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-		-	1 H-NMR** $\delta = 3.81 (3H)$
124	S CF ₃	0	-*CH ₂ -O-		-	1 H-NMR** $\delta = 5,08 (2H)$
125	F ₃ C S CH ₃	0	*-CH ₂ -O-		-	1 H-NMR** $\delta = 2,73 (3H)$

Tabelle 1 - Fortsetzung

		-				
Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
126	CF ₃	О	-*CH ₂ -O-			1 H-NMR** $\delta = 5,12 (2H)$
127	CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	—сн,	•	1 H-NMR** $\delta = 2,26 (3H)$
128	CF ₃	0	-*CH ₂ -()-	СН3	-	¹ H-NMR** δ = 1,86 (3H)
129	CI	0	-*CH ₂ -O-	сн,	-	1 H-NMR** $\delta = 2,24 (3H)$
130	CI	0	-*CH ₂ -O-	-	-	1 II-NMR** $\delta = 5,13 (2II)$
131	H ₃ C N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 3,69 (3H)$
132	F ₂ HC N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	¹ H-NMR** δ = 3,87 (3H)

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
133	F ₃ C N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 3,87 (3H)$
134	F ₃ C N S CH ₃	Ο	-*CH ₂ -O-	CH ₃	•	¹ H-NMR** δ = 2,73 (3H)
135	CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	•	1 H-NMR** $\delta = 5.14 (2H)$
136	CI	O	-*CH ₂ -O-	CH ₃	•	¹ H-NMR** δ = 2,06 (3H)
137	CF ₃	О	-*СН ₂ -О-	CH ₃	-	¹ H-NMR** δ = 5,11 (2H)

Tabelle 1 - Fortsetzung

				7	 	the state of the same and the same and
Bsp. Nr.	A	X	Q	Z	R _m	physik. Konstante
138	H ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 3.73 (3H)$
139	F ₂ HC N N CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 3.81 (3H)$
140	CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ³	-	1 H-NMR** $\delta = 5,09 (2H)$
141	CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	~	-	¹ H-NMR** δ = 2,26 (3H)
142	CH₃ CH₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 5,26 (2H)$
143	S CH3	0	-*CH ₂ -O-	————сн ₃		¹ H-NMR** δ = 2,29 (3H)

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	2	R _m	physik. Konstante
144	S CH ₃	О	-*CH ₂ -O-	CH ₃	•	¹ H-NMR** δ = 5,05 (3H)
145	H ₃ C CI	0	-*CH ₂ -O-			¹ H-NMR** δ = 3,75 (3H)
146	H ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	——Сн,	-	¹ H-NMR** δ = 5,04 (2H)
147	H ₃ C N N-CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	1 H-NMR** $\delta = 5,07 (3H)$
148	H ₃ C N N F CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	Fp. 122°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
149	H ₃ C N N F CH ₃	Ο	-*CH ₂ -SO-	————cн ₃	-	Fp. 69°C
150	H ₃ C N N F CH ₃	0	0		•	¹ H-NMR** δ = 2,39 (3H)
151	H ₃ C Z CH ₃	0	ἠ= 0		-	Fp. 166°C
152	OCHF ₂	0	0		-	Fp. 112-114°C
153	H ₃ C P CH ₃	0	-СН- ОН		-	Fp. 165°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
154	OCHF ₂	О	0	-(_)	-	Fp. 109-111°C
155	H ₃ C CI	0	ψ =0		-	Fp. 95-98°C
156	F ₃ C Z Z -CH	0	-С—О Н		-	Fp. 133-135°C
157	F ₃ C N N CH ₃	0	ç - 0		-	Fp. 160°C
158	F ₃ C	0	-CH- OH		-	Fp. 178°C

n.		T.,			7	
Bsp. Nr.	A	Х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
159	CI	0	Ç=0	-	-	Fp. 112°C
160	CI	О	-CH- OH		-	Fp. 133°C
161	H ₃ C N N CH ₃	O	ψ= 0		•	Fp. 147°C
162	H ₃ C N CH ₃	0	ү—о т		-	Fp. 63°C
163	F ₂ HC N N N-CH ₃	O	ἡ= 0		•	Fp. 142°C
164	F₂HC N N CH₃	Ο	-CH- OH		•	Fp. 145-148°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

	T					
Bsp. Nr.	۸	Х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
165	H ₃ C N N CH ₃	О	-CH=CH-		-	Fp. 133°C
166	OCHF ₂	О	-СН=СН-		-	Fp. 70-72°C
167	OCHF,	O	-CH- OH		•	$n_D^{20} = 1,5921$
168	CI	0	О		-	Fp. 100°C
169	OCHF ₂	0	т Ç—О		•	$n_D^{20} = 1,5985$
170	N F	0	•*CH ₂ -O-	сн,	•	Fp. 112°C
171	H ₃ C N N F CH ₃	0	•*CH ₂ •O•	CC	•	Fp. 94°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
172	H ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI	•	Fp. 109°C
173	H ₃ C N N CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	———сн ₃	•	Fp. 79°C
174	H ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	c	•	Fp. 99°C
175	H ₃ C N N CI CH ₃	Ο	-*СН ₂ -О-	CI CI	-	Fp. 110°C
176	H ₃ C N N CH ₃	0	-*СН ₂ -О-	CI CI	-	1 H-NMR** $\delta = 5,02 (2H)$

Tabelle 1 - Fortsetzung

		7	~			
Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
177	F ₂ HC N N CH ₃	О	-*CH ₂ -O-	CI	-	I H-NMR** $\delta = 5,06 (2H)$
178	CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	-C	•	Fp. 120°C
179	F ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI	-	1 H-NMR** $\delta = 5,06 (2H)$
180	F ₃ C N S CH ₃	Ο	-*СН ₂ -О-	CI		1 H-NMR** $\delta = 5,09 (2H)$
181	H ₃ C N N CI CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI	-	Fp. 115°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	А	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
182	H ₃ C N N CH ₃	О	-*CH ₂ -O-	CI	-	¹ H-NMR** δ = 5,18 (2H)
183	F ₃ C N N CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	ō	•	Fp. 114°C
184	F ₂ HC N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	C	-	Fp. 104°C
185	CF ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI	•	Fp. 137°C
186	CI	0	-*CH ₂ -O-	O C	-	Fp. 124°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
187	F ₃ C N S CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI	•	Fp. 103°C
188	F ₂ HC	0	-*CH ₂ -O-	-CI	-	¹ H-NMR** δ = 5,06 (2H)
189	F ₃ C N N-CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	-CI	-	1 H-NMR** $\delta = 5,05 (2H)$
190	H ₃ C N N CI	О	-*CH ₂ -O-	————cı	•	Fp. 143°C
191	F ₃ C N S CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	-CI	-	1 H-NMR** $\delta = 2,75 (3H)$

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	2	R _m	physik. Konstante
192	CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CI		Fp. 99°C
193	S CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	CI CI	•	1 H-NMR** $\delta = 2,27 (3H)$
194	S CH ₃	O	-*CH ₂ -O-	-CI	-	Fp. 116°C
195	F ₃ C N N-CH ₃	0	-*CH ₂ -O-	CH ₃	-	Fp. 88-90°C
196	F ₅ C ₂ CF ₃ CF ₃ N N CH ₃	Ο	Ο		•	m/e = 479
197	F ₃ C N N CH ₃	Ο	0	N CI	-	m/e = 397 λ _{max} = 262 mμ

<u>Tabelle 1</u> - Fortsetzung

Bsp. Nr.	A	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
198	CI	0	-*CH ₂ -O-	CF ₃	-	Fp. 131°C
199	H ₃ C N N CH ₃	0	-*CH ₂ -O-N H ₃ C-C	CF ₃	-	Fp. 94°С
200	F ₃ C N N CH ₃	Ο	-*CH ₂ -O-N H ₃ C-C	CF,	-	Fp. 120°C
201	C Z Z C C C	О	-*CH ₂ -O-N II H ₃ C-C	-⟨ CF ₃	-	Fp. 136°C
202	F ₂ HC N N CH ₃	Ο	-*CH ₂ -O-N II H₃C-C	CF ₃	-	Fp. 105°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp.	A	х		7		1
Nr.		l^	Q	Z	R _m	physik. Konstante
203	S CH ₃	0	-*CH ₂ -O-N		-	Fp. 76°C
204	H ₃ C N N CH ₃	Ο	-*CH ₂ -O-N H ₃ C-C	CF ₃	-	Fp. 97°C
205	CH ₃	O	-*СН ₂ -О-	СН,	•	m/c = 369 λ _{max} = 293 mμ
206	См³	0	0		•	1 H-NMR** $\delta = 2,60 (3H)$
207	CH ₃	O	0		-	Fp. 104°C
208	CH3	0	-СН=СН-	-(_)	•	Fp. 123°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	А	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
209	С СН3	0	-*CH ₂ -O-	CI	-	¹ H-NMR** δ = 5,12 (2H)
210	С√сн₃	O	-CH- OH		•	Fр. 143°С
211	С СН₃	O	-*CH ₂ -O-	—СН3	•	1 H-NMR** $\delta = 2,30 (3H)$
212	CH₃	0	-*СН ₂ -О-	-CI	•	Fp. 111°C
213	CIF ₂ C N N CH ₃	0	0		-	Fp. 99°С
214	CH ₃	0	0		-	Fp. 75°C

Tabelle 1 - Fortsetzung

Bsp. Nr.	Α	х	Q	Z	R _m	physik. Konstante
215	H ₃ C N C CH ₃	0	Ο		-	Fp. 95°C

- *) Der durch (*) gekennzeichnete Molekülteil ist jeweils mit dem Phenyl-Rest des Anilin-Teiles verbunden.
- **) Die ¹H-NMR-Spektren wurden in Deuterochloroform (CDCl₃) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als δ-Wert in ppm.

Verwendungsbeispiele

Beispiel A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

47 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator:

3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung taufeucht besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die
Pflanzen durch Bestäuben mit Konidien des Apfelmehltauerregers Podosphaera
leucotricha inokuliert.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

15 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der unbehandelten Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Tabelle A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Wirkungsgrad in % bei einer Wirkstoffkonzentration in der Spritzflüssigkeit von 100 ppm
Erfindungsgemäß: O II C-NH CF ₃ (8)	100
H ₃ C C-NH C-NH CH ₃	96
(9)	

- 93 -

Beispiel B

77 V 20/UJJUU

10

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

47 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung taufeucht besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei 23°C und einer relativen Luft-feuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

12 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der unbehandelten Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Tabelle B

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Wirkstoffloorgantsetion in des
	Wirkungsgrad in % bei einer Wirkstoffkonzentration in der Spritzflüssigkeit von 100 ppm
Erfindungsgemäß:	•
0	
C-NH—	83
CF ₃ O	
(8)	
0	
H ₃ C C-NH	83
 	
N, N O	
сн, 🕢 📎	
(9)	
F ₃ C	94
N. S O	
<u> </u>	
CH ₃	
(10)	
F ₃ C C-NH-	97
N,) CH=CH-	
N	
(16)	

<u>Tabelle B</u> (Fortsetzung)

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Wirkungsgrad in % bei einer Wirkstoffkonzentration in der Spritzflüssigkeit von 100 ppm
Erfindungsgemäß:	
F ₂ HC C-NH CH=CH	100
ĊH ₃ (20)	·
F_2HC $C-NH$ CH_2-S CH_3	100
N ' ' (46)	
F ₂ HC C-NH CH ₂ -O-CH ₃	95
O (50)	
F ₃ C C-NH-CH ₃ CH ₃	90
ĊH ₃ (195)	

Beispiel C

Pyrenophora teres-Test (Gerste) / protektiv

Lösungsmittel:

10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon

Emulgator:

0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Pyrenophora teres besprüht.

Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der unbehandelten Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

5

Tabelle C (Fortsetzung)

Pyrenophora teres-Test (Gerste) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmen- ge an Wirk- stoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß: O I F ₂ HC C N CH CH CH CH (20)	125	83
$F_{2}HC \longrightarrow C-NH \longrightarrow CH_{2}-S \longrightarrow CH_{3}$ $CH_{3} \longrightarrow CH_{3}$ CH_{2} $CH_{3} \longrightarrow CH_{3}$ $CH_{3} \longrightarrow CH_{3}$ $CH_{3} \longrightarrow CH_{3}$	125	75

Beispiel D

Pseudocercosporella herpotrichoides-Test; R-Stamm (Weizen) / protektiv

Lösungsmittel:

10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon

5 Emulgator:

0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man I Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen an der Halmbasis mit Sporen des R-Stammes von Pseudocercosporella herotrichoides inokuliert.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 10°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

21 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjeinigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Tabelle D

Pseudocercosporella herpotrichoides-Test; R-Stamm
(Weizen) / protektiv

5

Wirkstoff	Aufwandmen- ge an Wirk- stoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß: H ₃ C C-NH CH ₂ -O-N H ₃ C-C F ₃ C (199)	- 250	90

- 100 -

Beispiel E

Plutella-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (Plutella maculipennis) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

Tabelle E

Plutella-Test

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 d
Erfindungsgemäß: CF ₃ CO NH S (40)	0,1	100
F H_3C NH O CH_3 H_3C CH_3	0,1	100
CH ₃ S CO NH CI CI (77)	0,1	100

5

<u>Tabelle E</u> (Fortsetzung)

Plutella-Test

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 d
CH ₃ N CO NH S CI (81)	0,1	100
$CH_3 \longrightarrow NH O \longrightarrow CH_3$ $CH_3 \longrightarrow CH_3$ (111)	0,1	100
CO NH (124)	0,1	90
CF_3 CF_3 CH_3 CH_3 CH_3 CH_3 CH_3	0,1	100

5

Beispiel F

Spodoptera-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Eulenfalters (Spodoptera frugiperda) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

<u>Tabelle F</u>

Spodoptera-Test

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 d
Erfindungsgemäß:		
H_3C N CH_3 O O CH_3 O CH_3 O CH_3	0,1	100

WU 78/03000 FC 1/E/7 //03074

- 105 -

Beispiel G

Myzus-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea), die stark von der Pfirsichblattlaus (Myzus persicae) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Blattläuse abgetötet wurden.

Tabelle G

Myzus-Test

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 d
Erfindungsgemäß: O C C C C C C C C C C C C	0,1	95

WU 98/00000 PU 1/EF7 //00094

- 107 -

Beispiel H

Hemmtest an Riesenkolonien von Basidiomyceten.

Lösungsmittel:

Dimethylsulfoxid

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung werden 0,2 Gew.-Teile Wirkstoff mit 99,8 Gewichtsteilen des oben angegebenen Lösungsmittels versetzt.

Ein unter Verwendung von Malzextrakt-Pepton hergestellter Agar wird in flüssigem Zustand mit der Wirkstoffzubereitung in der jeweils gewünschten Aufwandmenge vermischt. Nach dem Aushärten wird der so hergestellte Nährstoffboden bei 26°C mit Mycelstücken inkubiert, die aus Kolonien von Coniophora puteana bzw. Coriolus versicolor ausgestochen wurden.

Nach 3- bzw. 7-tägiger Lagerung bei 26°C erfolgt die Auswertung, indem das Hyphenwachstum gemessen und die im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle aufgetretene Hemmung in Prozent bonitiert wird. Dabei bedeutet 0 % eine Wuchshemmung, die derjenigen der unbehandelten Kontrolle entspricht, während eine Wuchshemmung von 100 % bedeutet, daß kein Hyphenwachstum beobachtet wird.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle H

Hemmtest an Riesenkolonien von Basidiomyceten

Wirkstoff gemäß Beispiel-Nr.	b and 11) phon wachstains in 70 oct						
	Coniopho Wirkstof	ora puteana fkonzentrat	bei einer ion von	Coriolus Wirkstoff	Coriolus versicolor bei einer Wirkstoffkonzentration von		
	l ppm	3 ppm	6 ppm	l ppm	3 ppm	6 ppm	
5	70	80	100	70	90	100	
16	80	100	100	100	100	100	
18	70	100	100	70	100	100	
20	100	100	100 ·	100	100	100	
39	70	80	90	90	100	100	
40	50	60	70	40	70	90	
45	70	80	90	90	100	100	
46	80	100	100	100	100	100	
50	100	100	100	100	100	100	
52	80	90	100	90	100	100	
78	70	80	90	90	90	100	
81	70	90	100	90	90	100	
84	80	80	100	90	100	100	
85	70	80	80	70	70	90	
119	100	100	100	100	100	100	
123	100	100	100	100	100	100	
139	100	100	100	100	100	100	
141	80	100	100	90	100	100	

<u>Tabelle H</u> (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Beispiel-Nr.	Hemmung des Hyphenwachstums in % bei						
	Coniophora puteana bei einer Wirkstoffkonzentration von			ner Coriolus versicolor bei e Wirkstoffkonzentration			
142	70	90	100	90	90	100	
143	80	90	100	100	100	100	
144	70	90	100	90	100	100	

Beispiel J

Plasmopara-Test (Rebe) / protektiv

Lösungsmittel:

47 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

3 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Plasmopara viticola inokuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Inkubationskabine bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 5 Tage im Gewächshaus bei ca. 21°C und ca. 90 % Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Inkubationskabine gestellt.

6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor

Tabelle J
Plasmopara-Test (Rebe) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in
Erfindungsgemäß: CF ₃ CH ₂ -S-CH ₃	100	95
S CH ₂ S CH ₂ S	100	90

Beispiel K

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

47 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

3 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100°C relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

12 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle K

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß: S C-NH CH ₃ CH ₃	100	100

<u>Patentansprüche</u>

1. Carbanilide der Formel

$$A - C - NH - R_m$$

$$Q-Z$$
(I)

in welcher

5

R für Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkylthio mit I bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogenalkylthio mit I bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Carbalkoxy mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil oder Alkoximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im

15

10

Alkylteil steht,

m

für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Α für einen Rest der Formel

20

 \mathbb{R}^1 für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht und

- 10

15

R² für Wasserstoff, Halogen, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

A für einen Rest der Formel

R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4

R⁵ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen

Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

oder Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl
 mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4
 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogen steht,

oder

20 A für einen Rest der Formel

15

20

R⁹ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

10
$$R^{11}$$
 R^{10} steht, worin

R¹⁰ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

10

15

R¹² für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

X¹ für ein Schwefelatom, für SO, SO₂ oder -CH₂ steht,

oder

A für einen Rest der Formel

R¹³ für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

R¹⁴ für Halogen, Cyano, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15

A für einen Rest der Formel

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁷ für Wasserstoff, Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

oder

10 A für einen Rest der Formel

R¹⁸ für Wasserstoff, Halogen, Amino, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

R¹⁹ für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

10

R²⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, Cyano oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

R²¹ für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

R²² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

R²³ für Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

oder

A für einen Rest der Formel

15 Q für Alkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylen mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylen mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel

steht, worin

- R²⁴, R²⁵ und R²⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen stehen, oder
- 5 Q für eine Gruppe der Formel

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen stehen,

Y für ein Sauerstoffatom oder für S(O)_r steht, wobei

r für die Zahlen 0; 1 oder 2 steht, und

n und p unabhängig voneinander für die Zahlen 0, 1 oder 2 stehen,

wobei der durch (*) gekennzeichnete Molekülteil jeweils mit dem Phenylrest des Anilinteiles verbunden ist,

- 15 X für Sauerstoff oder Schwefel steht und
 - Z für gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Naphthyl, gegebenenfalls substituiertes Anthracenyl oder für gegebenenfalls substituiertes Hetaryl steht.
- Verfahren zur Herstellung von Carbaniliden der Formel (I) gemäß
 Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man
 - a) Säurehalogenide der Formel

in welcher

A und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel

5

15

$$H_2N \longrightarrow R_m$$
 (III)

in welcher

Q, R, Z und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

10 oder

b) Carbanilid-Derivate der Formel

$$\begin{array}{c} X \\ || \\ A-C-NH \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} R_m \\ \end{array}$$
 (IV)

in welcher

A, R, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X² für Sauerstoff oder Schwefel steht,

mit Verbindungen der Formel

10

15

- 122 -

$$\begin{array}{ccc}
E-(CH)_p-Z \\
I \\
R^{28}
\end{array} (V)$$

in welcher

R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

E für eine Austrittsgruppe steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

c) Carbanilid-Derivate der Formel

$$\begin{array}{c} X \\ II \\ A-C-NH \\ & \\ HC-E^1 \\ R^{27} \end{array}$$
 (VI)

in welcher

A, R, R²⁷, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben, und

E¹ für eine Austrittsgruppe steht,

mit Verbindungen der Formel

$$H-X^3-(CH)_p-Z$$

$$\downarrow VII$$
 R^{28}
(VII)

in welcher

R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X³ für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

d) Carbanilid-Derivate der Formel

in welcher

A, R, R²⁷, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Verbindungen der Formel

$$\begin{array}{ccc}
E-(CH)_p-Z \\
I \\
R^{28}
\end{array} (V)$$

in welcher

10 R²⁸, Z und p die oben angegebenen Bedeutungen haben und

E für eine Austrittsgruppe steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

e) Carbanilid-Derivate der Formel

$$A-C-NH \xrightarrow{R_m} (IX)$$

$$O=C \xrightarrow{R^{26}}$$

in welcher

WO 98/03500 PCT/EP97/03694

- 124 -

A, R, R²⁶, X und m die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Hydroxylamin-Derivaten der Formel

H₂N-O-Z

(X)

in welcher

5

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

- 3. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Carbanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1.
- Verwendung von Carbaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.
 - Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man Carbanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Schädlinge und/oder deren Lebensraum ausbringt.
- 15 6. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Carbanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

intern. .al Application No PCT/EP 97/03694

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 6 C07D333/38 A01 A01N37/22 CO7D231/14 C07D213/82 C07C233/75 CO7D277/56 C07D327/06 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC **B. FIELDS SEARCHED** Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 6 C07D Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Category * Relevant to claim No. X CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 106, no. 25, 1.3-6 22 June 1987 Columbus, Ohio, US; abstract no. 209380, CARMELLINO, M. L. ET AL: "Activity of some 2-iodobenzanilide derivatives on plant-pathogenic fungi" XP002044966 see 2-Iodo-N-[2-(phenylthio)phenyl]benzamid (RN=108350-96-5) see abstract FARMACO, ED. SCI. (1987), 42(3), 231-5 CODEN: FRPSAX:ISSN: 0430-0920. 1987. -/--Further documents are listed in the continuation of box C. X. Patent family members are listed in annex. * Special categories of cited documents : *T* later document published after the international filing date or pronty date and not in conflict with the application but "A" document defining the general state of the art which is not oited to understand the principle or theory underlying the considered to be of particular relevance invention "E" earlier document but published on or after the international *X* document of particular relevance; the claimed invention filing date cannot be considered novel or cannot be considered to document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such docu-"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means ments, such combination being obvious to a person skilled document published prior to the international filing date but later than the priority date clarined *&* document member of the same patent family Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report 0 7. 11. 97 31 October 1997 Name and mailing address of the ISA Authorized officer European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni, De Jong, B Fax: (+31-70) 340-3016

Interna .al Application No PCT/EP 97/03694

ategory *	continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT aggry * Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Relevant to claim No.				
utogory *	Outside of Goodstant, with induction, where appropriate, of the relevant passesses	· televanii (
(WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene carboxamide fungicides: structure-activity relationships with the succinate dehydrogenase complex from wild-type and carboxin-resistant mutant strains of Aspergillus nidulans" PESTIC. BIOCHEM. PHYSIOL. (1986), 25(2), 188-204 CODEN: PCBPBS; ISSN: 0048-3575, 1986, XP002045315 see compound VI	1,3-6			
	WO 95 25723 A (AGREVO UK LTD ;RIORDAN PETER DOMINIC (GB); BODDY IAN KENNETH (NZ);) 28 September 1995 see claims; examples	1,3-6			
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 115, no. 19, 11 November 1991 Columbus, Ohio, US; abstract no. 207662, MEGURO, KANJI ET AL: "Preparation of 2-amino-5-methylbenzophenones" XP002044968 see compounds with RN=136925-92-3; 136925-93-4; 136925-95-6; 136925-96-7; 136925-97-8; 136926-03-9 see abstract & JP 03 130 252 A (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD., JAPAN)	1			
	FUERSTNER, ALOIS ET AL: "Palladium-catalyzed arylation of polar organometallics mediated by 9-methoxy-9-borabicyclo[3.3.1]nonane: Suzuki reactions of extended scope" TETRAHEDRON (1995), 51(41), 11165-76 CODEN: TETRAB;ISSN: 0040-4020, 1995, XP002044964 see compound 15a	1			
X	FUERSTNER, ALOIS ET AL: ""Site Selective" Formation of Low-Valent Titanium Reagents: An "Instant" Procedure for the Reductive Coupling of Oxo Amides to Indoles" J. ORG. CHEM. (1994), 59(18), 5215-29 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 1994, XP002044965 see compounds 3j and 3k	1			
	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18 April 1972 see claims 1,2; table 1 -/	1			

Interns at Application No
PCT/EP 97/03694

		PCT/EP 97/03694
ategory °	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DE 19 13 178 A (LOVENS KEMISKE FABRIK) 23 October 1969 see the compounds of the Formula V	1
l	WO 93 11117 A (MONSANTO CO) 10 June 1993 cited in the application	1,3-6
	EP 0 589 301 A (BASF AG) 30 March 1994 cited in the application	1,3-6
ı	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9 June 1993 cited in the application	1,3-6
;		

Information on patent family members

Internu .al Application No
PCT/EP 97/03694

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9525723 A	28-09-95	AU 1898195 A	09-10-95
		CN 1143954 A	26-02-97
		CZ 9602690 A	11-12-96
		EP 0750611 A	02-01-97
		HU 74778 A	28-02-97
		PL 316289 A	06-01-97
		ZA 9502205 A	31-10 - 95
US 3657449 A	18-04-72	CA 942189 A	19-02-74
DE 1913178 A	23-10-69	AT 293413 A	15-09-71
		BE 729562 A	08-09-69
		CH 524626 A	30-06-72
		FR 2003898 A	14-11-69
		GB 1235381 A	16-06-71
		LU 58201 A	11-07-69
		NL 6903749 A	16-09-69
		SE 342633 B	14-02-72
		US 3674787 A	04-07-72
WO 9311117 A	10-06-93	US 5223526 A	29-06-93
		AT 149490 T	15-03-97
		AU 657598 B	16 - 03-95
		AU 3240793 A	28-06-93
		BR 9206869 A	28-11-95
		CA 2123122 A	10-06-93
		CZ 9401260 A	15-02-95
		DE 69217997 D	10-04-97
		DE 69217997 T	04-09-97
		EP 0623113 A	09-11-94
		HU 67795 A	28-04-95
		JP 7501549 T	16-02-95
		LT 234 A	15-06-94
		MD 940085 A	30-06-95
		MX 9207038 A	01-06-93
		NZ 246269 A	26-07-95
		SK 67894 A	08-02-95
		TR 26592 A	15-03-95
		ZA 9209441 A	25-08-93
		CN 1078234 A	10-11-93

Information on patent family members

Interna at Application No PCT/EP 97/03694

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0589301 A	30-03-94	DE 4231517 A AU 669732 B AU 4742293 A CA 2105503 A HU 68762 A JP 6199803 A NZ 248694 A US 5438070 A	20-06-96 31-03-94 22-03-94 28-07-95 19-07-94 28-03-95
EP 0545099 A	09-06-93	AT 149487 T AU 656243 B AU 2855492 A CA 2081935 A DE 59208113 D ES 2098421 T HU 213622 B JP 5221994 A NZ 245194 A PL 296677 A SK 344892 A US 5556988 A US 5589493 A US 5330995 A ZA 9208977 A	27-01-95 27-05-93 23-05-93 10-04-97 01-05-97 28-08-97 31-08-93 27-02-96 18-10-93 08-03-95 02-01-96 17-09-96 31-12-96 19-07-94

Intern. .nales Aktenzeichen PCT/EP 97/03694

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES 1PK 6 CO7D333/38 A01N37/22 CO7D231/14 C07D213/82 C07C233/75 C07D277/56 CO7D327/06 Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 6 C07D Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank, und sytt. verwendete Suchbegriffe) C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN Kategorie* Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit ertorderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile Betr. Anspruch Nr. X CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 106, no. 25, 1,3-6 22.Juni 1987 Columbus, Ohio, US; abstract no. 209380, CARMELLINO, M. L. ET AL: "Activity of some 2-iodobenzanilide derivatives on plant-pathogenic fungi" XP002044966 siehe 2-Iodo-N-[2-(phenylthio)phenyl]benzamid (RN=108350-96-5) siehe Zusammenfassung FARMACO, ED. SCI. (1987), 42(3), 231-5 CODEN: FRPSAX: ISSN: 0430-0920. 1987. -/--Weitere Veröffentlichungen eind der Fortsetzung von Feld C zu Siehe Anhang Patentfamilie lχ entrehmen Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen 'A' Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsem anzusehen ist Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er-scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden. Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie kann night als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet ausgeführt) en, wenn die Verüffentlichung mit einer oder mehreren anderen "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach
dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *&* Veröffentlichung, die Mitalied derselben Patentfamilie ist Datum des Abschlusses der internationalen Recherche Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 0 7. 11. 97 31.0ktober 1997 Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Bevollmächtigter Bediensteter Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nt. De Jong, B Fax: (+31-70) 340-3016

Intern. nales Aktenzeichen
PCT/FP 97/03694

Fortsetz	Izung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN				
orie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, sowet erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden 1	Feile Betr. Anspruch Nr.			
	WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene carboxamide fungicides: structure-activity relationships with the succinate dehydrogenase complex from wild-type and carboxin-resistant mutant strains of Aspergillus nidulans" PESTIC. BIOCHEM. PHYSIOL. (1986), 25(2), 188-204 CODEN: PCBPBS; ISSN: 0048-3575, 1986, XP002045315 siehe Verbindung VI	1,3-6			
	WO 95 25723 A (AGREVO UK LTD ;RIORDAN PETER DOMINIC (GB); BODDY IAN KENNETH (NZ);) 28.September 1995 siehe Ansprüche; Beispiele	1,3-6			
	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 115, no. 19, 11.November 1991 Columbus, Ohio, US; abstract no. 207662, MEGURO, KANJI ET AL: "Preparation of 2-amino-5-methylbenzophenones" XP002044968 siehe Verbindungen mit RN=136925-92-3; 136925-93-4; 136925-95-6; 136925-96-7; 136925-97-8; 136926-03-9 siehe Zusammenfassung & JP 03 130 252 A (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD., JAPAN)				
	FUERSTNER, ALOIS ET AL: "Palladium-catalyzed arylation of polar organometallics mediated by 9-methoxy-9-borabicyclo[3.3.1]nonane: Suzuki reactions of extended scope" TETRAHEDRON (1995), 51(41), 11165-76 CODEN: TETRAB;ISSN: 0040-4020, 1995, XP002044964 siehe Verbindung 15a	1			
	FUERSTNER, ALOIS ET AL: ""Site Selective" Formation of Low-Valent Titanium Reagents: An "Instant" Procedure for the Reductive Coupling of Oxo Amides to Indoles" J. ORG. CHEM. (1994), 59(18), 5215-29 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 1994, XP002044965 siehe Verbindungen 3j und 3k				
	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18.April 1972 siehe Ansprüche 1,2; Tabelle 1	1			

Intern. .ales Aktenzeichen
PCT/EP 97/03694

Enri	Ortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN				
one°	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommer	iden Telle	Betr. Anapruch Nr.		
		-	,		
	DE 19 13 178 A (LOVENS KEMISKE FABRIK) 23.Oktober 1969 siehe Verbindungen der Formel V		1		
	WO 93 11117 A (MONSANTO CO) 10.Juni 1993 in der Anmeldung erwähnt		1,3-6		
	EP 0 589 301 A (BASF AG) 30.März 1994 in der Anmeldung erwähnt		1,3-6		
	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9.Juni 1993 in der Anmeldung erwähnt		1,3-6		
		:			

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selban Patantfamilie gehören

Interna Jes Aktenzeichen
PCT/EP 97/03694

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9525723 A	28-09-95	AU 1898195 A CN 1143954 A CZ 9602690 A EP 0750611 A HU 74778 A PL 316289 A ZA 9502205 A	09-10-95 26-02-97 11-12-96 02-01-97 28-02-97 06-01-97 31-10-95
US 3657449 A	18-04-72	CA 942189 A	19-02-74
DE 1913178 A	23-10-69	AT 293413 A BE 729562 A CH 524626 A FR 2003898 A GB 1235381 A LU 58201 A NL 6903749 A SE 342633 B US 3674787 A	15-09-71 08-09-69 30-06-72 14-11-69 16-06-71 11-07-69 16-09-69 14-02-72
WO 9311117 A	10-06-93	US 5223526 A AT 149490 T AU 657598 B AU 3240793 A BR 9206869 A CA 2123122 A CZ 9401260 A DE 69217997 D DE 69217997 T EP 0623113 A HU 67795 A JP 7501549 T LT 234 A MD 940085 A MX 9207038 A MX 9207038 A MX 246269 A SK 67894 A TR 26592 A ZA 9209441 A CN 1078234 A	29-06-93 15-03-97 16-03-95 28-06-93 28-11-95 10-06-93 15-02-95 10-04-97 04-09-97 09-11-94 28-04-95 16-02-95 15-06-94 30-06-95 01-06-93 26-07-95 08-02-95 15-03-95 25-08-93 10-11-93

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interna ales Aktenzeichen
PCT/EP 97/03694

im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0589301 A	30-03-94	DE 4231517 A	24-03-94
		AU 669732 B	20-06-96
		AU 4742293 A	31-03-94
		CA 2105503 A	22-03-94
		HU 68762 A	28-07-95
		JP 6199803 A	19-07-94
		NZ 248694 A	28-03-95
		US 5438070 A	01-08-95
EP 0545099 A	09-06-93	AT 149487 T	15-03-97
Er 0343033 A	0, 00 ,	AU 656243 B	27-01-95
		AU 2855492 A	27-05-93
		CA 2081935 A	23-05-93
		DE 59208113 D	10-04-97
		ES 2098421 T	01-05-97
		HU 213622 B	28-08-97
		JP 5221994 A	31-08-93
		NZ 245194 A	27-02-96
		PL 296677 A	18-10-93
		SK 344892 A	08-03-95
		US 5480897 A	02-01-96
		US 5556988 A	17-09-96
		US 5589493 A	31-12-96
		US 53309 <u>95</u> A	19-07-94
		ZA 9208977 A	19-05-94